

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
11. August 2005 (11.08.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2005/073213 A2

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 317/44,  
491/08, 209/52

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/000643

(22) Internationales Anmeldedatum:  
24. Januar 2005 (24.01.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
04002055.4 30. Januar 2004 (30.01.2004) EP

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): LONZA AG (CH/CH); Münchensteinerstrasse 38,  
CH-4052 Basel (CH).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GRIFFITHS,  
Gareth-John (GB/CH); Bäretstrasse 2a, CH-3930  
Visp (CH). LANGE, Silvia (DE/CH); Bielastrasse 79,

CH-3900 Brig (CH). BRIEDEN, Walter (DE/CH);  
Bleika, CH-3938 Ausserberg (CH).

(74) Gemeinsamer Vertreter: LONZA AG; Münchensteiner-  
strasse 38, CH-4052 Basel (CH).

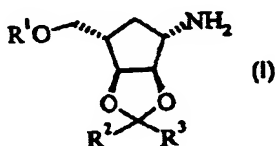
(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,  
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,  
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,  
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,  
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,  
PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,  
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHOD FOR THE PRODUCTION OF 3-AMINO-5-(HYDROXYMETHYL)CYCLOPENTANE-1,2-DIOL  
DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 3-AMINO-5-(HYDROXYMETHYL)CYCLOPENTAN-1,2-DI-  
OLDERIVATEN



(I)



(II)

(57) Abstract: The invention relates to a method for the production of acetals and ketals of 3-amino-5-(hydroxymethyl)cyclopentane-1,2-diols of formula (I) (and/or the enantiomer), where R<sup>1</sup> = H, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>3-8</sub> cycloalkyl or benzyl and i) R<sup>2</sup> = methyl and R<sup>3</sup> = ethyl, ii) R<sup>2</sup> = H and R<sup>3</sup> = C<sub>1-6</sub> alkyl or phenyl or iii) R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> together form a group of formula -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>- with n = 4 to 6, present as free amines or as salts of di- or tri-basic organic acids, starting from 2-acetyl-2-aza-bicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one of formula (II) (and/or the enantiomer). The method is equally useful, depending on the starting material, for the production of enantiomerically-pure compounds, or mixtures with arbitrary enantiomeric content.

(57) Zusammenfassung: Gegenstand der Erfindung ist ein Verfahren zur Herstellung von Acetalen und Ketalen von 3-Amino-5-(hydroxymethyl)cyclopentan-1,2-diolen der Formel (I) und/oder Spiegelbild worin R<sup>1</sup> Wasserstoff, C<sub>1-6</sub>-Alkyl, C<sub>3-8</sub>-Cycloalkyl oder Benzyl ist und worin i) R<sup>2</sup> Methyl und R<sup>3</sup> Ethyl, ii) R<sup>2</sup> Wasserstoff und R<sup>3</sup> C<sub>1-6</sub>-Alkyl oder Phenyl oder iii) R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> zusammen eine Gruppe der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>- mit n = 4 bis 6 bedeuten, und die als freie Amine oder als Salze zwei- oder dreibasiger organischer Säuren vorliegen, ausgehend von 2-Acetyl-2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on der Formel (II) und/oder Spiegelbild Das Verfahren ist, abhängig von der Zusammensetzung des Eduktes, gleichermassen geeignet zur Herstellung enantiomerenreiner Verbindungen oder von Gemischen beliebiger Enantiomerenzusammensetzung.